

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 05-255100 ✓

(43)Date of publication of application : 05.10.1993

(51)Int.Cl.

A61K 35/78

A61K 35/78

A61K 35/78

(21)Application number : 04-053558

(71)Applicant : LOTTE CO LTD

(22)Date of filing : 12.03.1992

(72)Inventor : SHIMURA SUSUMU

(54) LIPASE INHIBITOR

(57)Abstract:

PURPOSE: To provide a highly safe lipase inhibitor having substantially highly inhibitory activity on the lipase present in the pancreas, thus contributing to obesity prevention or suppression along with being applicable to preventing the deterioration of or offensive odor generation from foods, etc., due to such lipase.

CONSTITUTION: The objective lipase inhibitor containing, as active ingredient, a polar or nonpolar solvent extract of at least one kind of crude drug selected from Notopterygii rhizoma, Alpiniae officinarum rhizoma, arecae semen, Myricae cortex, Cassiae nictitans, and Cassiae torae semen.

[First Hit](#) [Previous Doc](#) [Next Doc](#) [Go to Doc#](#)

End of Result Set

☐ [Generate Collection](#) [Print](#)

L3: Entry 99 of 99

File: DWPI

Oct 5, 1993

DERWENT-ACC-NO: 1993-348356

DERWENT-WEEK: 199721

COPYRIGHT 2006 DERWENT INFORMATION LTD

TITLE: Lipase inhibitors e.g. used to prevent obesity - contain (non)polar solvent extracts of medicinal plants e.g. Dokkatsu, Ryokyo, Yobaihi, etc.

PATENT-ASSIGNEE:

ASSIGNEE

CODE

LOTTE CO LTD

LOTT

PRIORITY-DATA: 1992JP-0053558 (March 12, 1992)

[Search Selected](#)

[Search ALL](#)

[Clear](#)

PATENT-FAMILY:

PUB-NO	PUB-DATE	LANGUAGE	PAGES	MAIN-IPC
<input type="checkbox"/> JP 05255100 A	October 5, 1993		004	A61K035/78
<input type="checkbox"/> JP 2602387 B2	April 23, 1997		004	A61K035/78

APPLICATION-DATA:

PUB-NO	APPL-DATE	APPL-NO	DESCRIPTOR
JP 05255100A	March 12, 1992	1992JP-0053558	
JP 2602387B2	March 12, 1992	1992JP-0053558	
JP 2602387B2		JP 5255100	Previous Publ.

INT-CL (IPC): A61K 35/78

ABSTRACTED-PUB-NO: JP 05255100A

BASIC-ABSTRACT:

Lipase inhibitors contain active substances of extract obtd. by extraction of crude medicated materials consisting of Dokkatsu (Angelica pubescens), Ryokyo (Alpina officinarum), Binroshi (Areca Catechu), Yobaibi (Myrica rubra) Sanpenzu (Cassia nomame), and/or Ketsumeishi (Cassia obtusifolia), using polar or non-polar solvents. Pref. the solvent is water (or buffer) or organic solvent (e.g. hexane, ether, chloroform, tetrahydrofuran, methanol or ethanol).

USE/ADVANTAGE - The lipase inhibitors are used for prevention of obesity, or preventives for undesirable smells from foods.

In an example, dried crude material was cut into pieces, homogenised with McIlvaine buffer, or tetrahydrofuran, and extracted for 1 day. The extract soln. was

filtered.

CHOSEN-DRAWING: Dwg.0/0

TITLE-TERMS: LIPASE INHIBIT PREVENT OBESITY CONTAIN NON POLE SOLVENT EXTRACT
MEDICINE PLANT

DERWENT-CLASS: B04

CPI-CODES: B04-A07F2; B12-G01B3;

CHEMICAL-CODES:

Chemical Indexing M1 *01*
Fragmentation Code
M423 M781 M903 P616 Q225 V400 V406 V813

SECONDARY-ACC-NO:

CPI Secondary Accession Numbers: C1993-154511

[Previous Doc](#)

[Next Doc](#)

[Go to Doc#](#)

* NOTICES *

JPO and NCIPi are not responsible for any damages caused by the use of this translation.

1. This document has been translated by computer. So the translation may not reflect the original precisely.
2. **** shows the word which can not be translated.
3. In the drawings, any words are not translated.

CLAIMS

[Claim(s)]

[Claim 1] The lipase inhibitor characterized by making into an active principle the polarity of the crude drug more than a kind chosen from the group which consists of Angelica pubescens, Alpiniae officinari rhizoma, bottle ROUSHI, dried myrica, SAMPENZU, and a cassia seed, or a nonpolar solvent extract extract.

[Translation done.]

DETAILED DESCRIPTION

[Detailed Description of the Invention]

[0001]

[Industrial Application] This invention relates to lipase inhibitor with the high safety which can be used for degradation of the food resulting from lipase etc., or prevention of offensive odor generating while it checks effectively in more detail the pancreatic lipase which grasps the key of obesity which does not boil the digestion of a lipid in the living body about a lipase inhibitor and can contribute to control and prevention of obesity.

[0002]

[Description of the Prior Art] In Homo sapiens, lipase (pancreatic lipase) is working as a key enzyme of the digestion of a lipid, and development of the drugs which check pancreatic lipase, control obesity or are prevented is tried conventionally. For example, the obesity preventive indicated by OKISETANON and JP,1-102022,A which were indicated by the anti-obesity indicated by JP,55-98114,A and a triglyceride reduction agent, and JP,61-152663,A can be illustrated.

[0003] Moreover, the extraction method (JP,49-41580,A) of the inhibitor from the seed which was rich in the eating-and-drinking article (JP,64-34264,A) which added the inhibitor separated from cereals and legumes for the same object, or the fat etc. is indicated.

[0004] It is known that keep and the tannin of a leaf (Fodder plant) checks lipase on the other hand (British J. Nutrition, 60,275 (1988)) or that the extract (tannin) of beans (Field bean) will check lipase (J. Sci. Food Agric., 30,458 (1979)). Moreover, it is reported that the protein from an soybean, cereals, and a Japanese radish seed checks this ((Agric. Biol. Chem., 37 and 1225, 1973), Nurt. Rep. Int., 32 and 1107 (1985), a Japanese food-stuff-industry meeting magazine, 35,430 (1988)). Furthermore, a hemicellulose, wheat wheat bran, etc. have a report of the lipase inhibition by the phosphatidylcholine (73 the Meiji University agricultural department research report, 9 (1986)) of an soybean (J. Food Sci., 49,956 (1984), Am.J.Clin. Nutr., 42,629 (1985)) seed, a myo inositol (J. Food Sci., 53,250 (1988)), etc.

[0005] About crude drugs, the extract of 14 sorts of crude drugs, such as a peony, Olen, OOBaku, BOTAMBI, a Geranium thunbergii Sieb. etZucc., and tea, is indicated as a thing to microorganism lipase (JP,64-90131,A). Moreover, the result of having investigated inhibitory action is reported about 25 sorts of crude drugs as a thing to microorganism lipase (69 the Meiji University agricultural department research report, 15 (1985)).

[0006] Furthermore, recently, the lipid absorption control food (JP,3-228664,A) characterized by blending the lipase inhibitor (JP,3-219872,A) which consists of a water extract of a green pepper, a Japanese pumpkin, a Shimeji mushroom, maitake mushrooms, edible brown algae, green tea, tea, and oolong tea, and the epigallocatechin gallate which is the main components in green tea is indicated.

[0007]

[Problem(s) to be Solved by the Invention] A natural crude drug has high safety and it is known that there is various drug effect. From the extract of the crude drugs of these many, it searched for what checks lipase activity, and traced that remarkable high inhibitory action was in several sorts of crude drug extracts lately.

[0008] This invention shows remarkable high inhibitory action to the pancreatic lipase which manages the digestion of a lipid in the living body, and grasps the key of obesity, and it aims at offering a lipase inhibitor with the high safety which can be used for degradation of the food resulting from lipase etc., or prevention of offensive odor generating while it checks this and can contribute to control and prevention of obesity.

[0009]

[Means for Solving the Problem] According to this invention, the lipase inhibitor characterized by making into an active principle the polarity of the crude drug more than a kind chosen from the group which consists of Angelica pubescens, Alpiniae officinari rhizoma, bottle ROUSHI, dried myrica, SAMPENZU, and a cassia seed, or a nonpolar solvent extract extract is offered.

[0010] Angelica pubescens (German **) is Angelica. pubescens It is the root of Maximowicz (angelica),

and in Chinese medicine, cold is left as sweating and a sad medicine of the ** style, and it is supposed that there is effectiveness which scatters an edema. It is shown that Glabra-lactone and Angelical (7-Methoxy-6-coumarinaldehyde) exist in a root.

[0011] *Alpiniae officinari rhizoma* (gayangae rhizoma) is Zingiberaceae KOURYOUKYOU and *Alpina. officinarum* The rhizome of Hance (generic name galanga) is called *Alpiniae officinari rhizoma*.

[0012] Bottle ROUSHI (areca nut) is the *Palmae* bottle low and Areca. Catechu It is the seed with which L. matured and MARAYA, Indonesia, and the Philippines are places of production. Arecoline, Arecadin, Guvacine, etc. exist in it and it is supposed that there is effectiveness of parasitic clearance and paropsis recovery them. MARAYA people and the people from Taiwan have **** habit in this.

[0013] Dried myrica (*Myrica rubra* bark) is a bayberry and *Myrica. rubra* Siebold et It is the bark of Zuccarini and produces in various parts of Kyushu. It is known that tannin, Myricetin, etc. exist. It is supposed in Chinese medicine that there is an effect of diarrhea, or ***** and detoxication. There is the urination effectiveness in Myricetin.

[0014] SAMPENZU (*Cassia nomame*(Sieb.)Honda) is a cassia and *Cassia. nomame* Honda (*Cassia mimosoides* L. var. *nomame* Makino) The forage of a **** term is dried and it produces all over the country. Tea is comparatively drunk as **** and bean tea. In Chinese medicine, it is supposed that there are urination and the bottom effectiveness of **. It is supposed that a side effect does not have a lot of drink, either.

[0015] A cassia seed (cassia seed) is the seed with which *Cassia obtusifolia* (*Cassia obtusifolia* L.) matured, and is native [of tropical Asia]. In Chinese medicine, it is supposed that there are an operation under **, sthenia, and an eyesight improvement effect. Emodin, Obtusifolin, etc. are known by the component. It is called hub tea and tea is drunk comparatively.

[0016] Although it faces extracting an active principle from these crude drugs and an extracting solvent can choose a suitable thing from water (or buffer solution) or organic solvents (for example, a hexane, the ether, chloroform, benzene, toluene, ethyl acetate, a tetrahydrofuran, a butanol, propanol, an acetone, ethanol, a methanol, etc.) more than a kind, about *Angelica pubescens*, *Alpiniae officinari rhizoma*, bottle ROUSHI, and dried myrica, it is desirable to use water or the buffer solution. *Angelica pubescens*, bottle ROUSHI, dried myrica, etc. which can be suitably used in the range of pH 3.0-10.0 as the buffer solution can be illustrated. On the other hand, about SAMPENZU and a cassia seed, it is desirable to use organic solvents, such as THF.

[0017] Said crude drug extract extract can be diluted with a suitable solvent, or can be condensed and used. Moreover, it can be used for the shape of the shape of a paste, and powder, carrying out by actuation of attraction, freeze drying, etc. Moreover, it can also mix beforehand for food etc., and these can be pharmaceutical-preparation-ized suitably, and can be used as a lipase inhibitor.

[0018]

[Function] This invention relates to the lipase inhibitor which makes an active principle the polarity of the crude drug more than a kind chosen from the group which consists of *Angelica pubescens*, *Alpiniae officinari rhizoma*, bottle ROUSHI, dried myrica, SAMPENZU, and six sorts of crude drugs of a cassia seed, or a nonpolar solvent extract extract.

[0019] These extracts have effectiveness higher than the tea extract made higher [lipase inhibitory action] than before, and since these extracts are not the composite matter but the things of the natural vegetable origin, they can offer inhibitor with high safety.

[0020] Moreover, these extracts are applicable to the obesity prevention based on inhibition of the digestion of fats and oils, prevention of the disease resulting from lipase, and prevention. Furthermore, these extracts are applicable to degradation of the food resulting from lipase etc., and prevention of generating of an offensive odor.

[0021]

[Effect of the Invention] While according to this invention remarkable high inhibitory action is shown to the pancreatic lipase which manages the digestion of a lipid in the living body, and grasps the key of obesity, checking this and being able to contribute to control and prevention of obesity, a lipase inhibitor with the high safety which can be used for degradation of the food resulting from lipase etc. or

prevention of offensive odor generating is offered.

[0022] The lipase inhibitor of this invention controls the activity of lipase powerfully and effectively, and since it is the natural product origin unlike synthetic material, its safety is high.

[0023] Moreover, this invention article is applicable to degradation prevention of food etc., such as prevention of the offensive odor accompanying disassembly of the fats and oils with which lipase is considered as a cause, etc. while it is applicable to the obesity prevention by lipase inhibition, and prevention of the various diseases from which lipase happens owing to and prevention.

[0024]

[Example] Although an example explains this invention further below at a detail, this invention is not limited only to the following examples.

[0025] Measurement of example 1-1 (lipase activity measurement method) lipase activity used the oleate (4-MUO) of the 4-methylumbelliferone of fluorescence for the substrate, and was performed by measuring the fluorescence of the 4-methylumbelliferone generated by the reaction.

[0026] 4-MUO suspension 100microl which is a substrate, Buta pancreatic lipase (product made from Sigma) solution 50microl, and 50micro of buffer solutions 1 were taken to the small examiner, and it was made to react for 20 minutes at 37 degrees C eventually on condition that 4-MUO 0.05mM and Buta pancreatic lipase 2.2microg and the McIlvaine buffer solution (pH7.4). After having added 1ml of 0.1-N hydrochloric acids, having stopped the reaction, adding 2ml of 0.1M sodium citrates and making pH of a solution into the 4.3 neighborhoods, the fluorescence (excitation wavelength of 320nm, fluorescence wavelength of 450nm) of the 4-methylumbelliferone generated by the reaction was measured with the fluorophotometer.

[0027] The crude drug which carried out example 1-2 (preparation of extract extract) desiccation was ground, the McIlvaine buffer solution of an amount was added 50 times to the grinding object, day immersion was carried out after homogenization and the homogenizer extracted. This was filtered and the filtrate was used as the extract extract. Moreover, depending on the crude drug, it extracted by the following approaches. Day extract cleaning was carried out by the hexane of an amount 5 times to the grinding object, after attraction desiccation, the tetrahydrofuran of an amount was added 5 times, this extract residue was filtered after the day extract, and this filtrate was used as the extract extract.

[0028] Measurement of the inhibition effectiveness of an extract extract exerted on example 1-3 (measurement of effectiveness of extract extract) lipase activity made the extract extract add and react to the system of measurement of the lipase activity shown in said example, and was performed by investigating the effect to activity.

[0029] To the extract extracted with the McIlvaine buffer solution, extract 50microl was added instead of 50micro of buffer solutions 1 of the system of reaction, and 5microl was added about the extract extracted in THF. In addition, what carried out tales-doses addition of the same solvent as an extract was considered as contrast, and the activity at the time of extract addition was shown as relative activity over contrast.

[0030] an example 1-4 (comparison of various extract extracts) -- according to said example, the effect affect the lipase activity of the extract extract of various kinds of crude drugs was investigated. The result is shown in a table 1.

[0031]

[A table 1]

生薬抽出物のリパーゼ活性への影響

生薬	抽出溶媒	相対活性 (%)
ドッカツ	緩衝液	7
リョウキョウ	"	9
ピンロウシ	"	4
ヨウバイヒ	"	0. 4
サンペンズ	T H F	1
ケツメイシ	"	2
茶	緩衝液	1 1

[0032] Although it was known that lipase inhibitory action is high about a tea extract extract, it turned out that these crude drug extract extracts have lipase inhibitory action clearly higher than a tea extract extract so that clearly from a table 1.

[Translation done.]

(19)日本国特許庁(JP)

(12) 公開特許公報(A)

(11)特許出願公開番号

特開平5-255100

(43)公開日 平成5年(1993)10月5日

(51)Int.Cl. ⁵	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
A 6 1 K 35/78	ADN C	7180-4C		
	W	7180-4C		
	ACN J	7180-4C		

審査請求 未請求 請求項の数1(全 4 頁)

(21)出願番号 特願平4-53558

(22)出願日 平成4年(1992)3月12日

(71)出願人 390002990

株式会社ロッテ

東京都新宿区西新宿3丁目20番1号

(72)発明者 志村 進

茨城県牛久市牛久町356-113

(74)代理人 弁理士 浜田 治雄

(54)【発明の名称】 リパーゼ阻害剤

(57)【要約】

【目的】 生体内で脂質の消化吸収を司り肥満症の鍵を握る腓リパーゼに対して著しく高い阻害作用を示し、これを阻害して肥満の抑制や予防に寄与し得ると共に、リパーゼに起因する食品等の劣化や悪臭発生の防止に利用することができる安全性の高いリパーゼ阻害剤を提供する。

【構成】 ドッカツ、リョウキョウ、ビンロウシ、ヨウバイヒ、サンベンズおよびケツメイシよりなる群から選択される一種以上の生薬の極性もしくは非極性溶媒抽出エキスを有効成分とするリパーゼ阻害剤。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 ドッカツ、リョウキョウ、ビンロウシ、ヨウバイヒ、サンベンズおよびケツメイシよりなる群から選択される一種以上の生薬の極性もしくは非極性溶媒抽出エキスを有効成分とすることを特徴とするリパーゼ阻害剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】本発明はリパーゼ阻害剤に関し、更に詳しくは、生体内で脂質の消化吸収をにない肥満症の鍵を握る腓リパーゼを有効に阻害して肥満の抑制や予防に寄与し得ると共に、リパーゼに起因する食品等の劣化や悪臭発生防止に利用することができる安全性の高いリパーゼ阻害物質に関する。

【0002】

【従来の技術】ヒトにおいてリパーゼ（腓リパーゼ）は脂質の消化吸収のキーマンとして働いており、腓リパーゼを阻害して肥満症を抑制したり予防する薬剤の開発が従来より試みられている。例えば、特開昭55-98114号に記載された抗肥満及びトリグリセリド減少剤、特開昭61-152663号に記載されたオキセタノン類および特開平1-102022号に記載された肥満予防剤等を例示することができる。

【0003】また、同様の目的で、穀類、豆類から分離した阻害物質を添加した飲食品（特開昭64-34264号）や脂肪に富んだ種子からの阻害物質の抽出法（特開昭49-41580号）等が開示されている。

【0004】一方、飼料（Fodder plant）のタンニン類がリパーゼを阻害することや（British J. Nutrition, 60, 275 (1988)）、豆（Field bean）の抽出物（タンニン）がリパーゼを阻害することが知られている（J. Sci. Food Agric., 30, 458 (1979)）。また大豆や穀類、大根種子からの蛋白質がこれを阻害することが報告されている（Agric. Biol. Chem., 37, 1225, (1973)、Nurt. Rep. Int., 32, 1107 (1985)、日本食品工業会誌、35, 430 (1988)）。更にヘミセルロースや小麦ふすま等（J. Food Sci., 49, 956 (1984)、Am. J. Clin. Nutr., 42, 629 (1985)）、大豆種子のフォスファチジルコリン（明治大学農学部研究報告、73, 9 (1986)）、ミオイノシトール（J. Food Sci., 53, 250 (1988)）等によるリパーゼ阻害に関する報告がある。

【0005】生薬類については微生物リパーゼに対するものとして、シャクヤク、オオレン、オオバク、ボタンビ、ゲンノショウコ、茶等の14種の生薬の抽出物が開示されている（特開昭64-90131号）。また微生

物リパーゼに対するものとして25種の生薬について阻害作用を調べた結果が報告されている（明治大学農学部研究報告、69, 15 (1985)）。

【0006】更に最近では、ピーマン、かぼちゃ、しめじ、まいたけ、ひじき、緑茶、紅茶、ウーロン茶の水抽出物からなるリパーゼ阻害剤（特開平3-219872号）や、緑茶中の主要な成分であるエピガロカテキンガレート配合することを特徴とする脂質吸収抑制食品（特開平3-228664号）が開示されている。

【0007】

【発明が解決しようとする課題】天然の生薬は安全性が高く、種々の薬効があることが知られている。これら多くの生薬類の抽出物より、リパーゼ活性を阻害するものを探索し、数種の生薬抽出物に著しく高い阻害作用があることをこの度突き止めた。

【0008】本発明は、生体内で脂質の消化吸収を司り肥満症の鍵を握る腓リパーゼに対して著しく高い阻害作用を示し、これを阻害して肥満の抑制や予防に寄与し得ると共に、リパーゼに起因する食品等の劣化や悪臭発生防止に利用することができる安全性の高いリパーゼ阻害剤を提供することを目的とする。

【0009】

【課題を解決するための手段】本発明によれば、ドッカツ、リョウキョウ、ビンロウシ、ヨウバイヒ、サンベンズおよびケツメイシよりなる群から選択される一種以上の生薬の極性もしくは非極性溶媒抽出エキスを有効成分とすることを特徴とするリパーゼ阻害剤が提供される。

【0010】ドッカツ（独活）は、*Angelica pubescens Maximowicz*（シシウド）の根であり、漢方では発汗、駆風、沈痛薬として風邪を去り、浮腫を散らす効果があるとされている。根にはGlabra-lactone、Angelical (7-Methoxy-6-coumarinaldehyde) が存在することが示されている。

【0011】リョウキョウ（良姜）は、ショウガ科コウリョウキョウ、*Alpinia officinarum* Hance（一般名galanga）の根茎をリョウキョウと呼ぶものである。

【0012】ビンロウシ（檳榔子）は、ヤシ科ビンロウ、*Areca Catechu* L. の成熟した種子であり、マラヤ、インドネシア、フィリピンが産地である。Arecoline、Arecadin、Guvacine等がその中に存在し、寄生虫除去、視力障害治療の効果があるとされる。マラヤ人、タイワン人はこれを咬む習慣がある。

【0013】ヨウバイヒ（楊梅皮）は、ヤマモモ、*Myrica rubra Siebold et Zuccarini* の樹皮であり、九州各地に産する。タンニン、Myricetin等が存在することが知られている。漢方では下痢や打撲症、解毒の効があるとされる。

Myricetinには利尿効果がある。

【0014】サンベンズ(山扁豆)は、カワラケツメイ、*Cassia nomame* Honda (*Cassia mimosoides* L. var. *nomame* Makino)の帯果期の茎葉を乾燥したものであり、全国各地に産する。浜茶、マメ茶として茶がわりに飲用される。漢方では利尿や緩下効果があるとされる。多量の飲用でも副作用はないとされる。

【0015】ケツメイシ(決明子)は、エビスグサ(*Cassia obtusifolia* L.)の成熟した種子であり、熱帯アジアの原産である。漢方では緩下作用、強壮、視力改善効果があるとされる。成分にはEmodin、Obtusifolin等が知られている。ハブ茶と呼ばれ茶がわりに飲用される。

【0016】これらの生薬から有効成分を抽出するに際し、抽出溶媒は水(もしくは緩衝液)または有機溶媒(例えばヘキサン、エーテル、クロロホルム、ベンゼン、トルエン、酢酸エチル、テトラヒドロフラン、ブタノール、プロパノール、アセトン、エタノール、メタノール等)より適切なものを一種以上選択することができるが、ドッカツ、リョウキョウ、ビンロウシ、ヨウバイヒについては、水もしくは緩衝液を用いることが望ましい。緩衝液としては、pH3.0~10.0の範囲で好適に使用することができるドッカツ、ビンロウシおよびヨウバイヒ等を例示することができる。一方、サンベンズ、ケツメイシについてはTHF等の有機溶媒を用いることが好ましい。

【0017】前記生薬抽出エキ스는適切な溶媒で希釈したり、あるいは濃縮して使用することができる。また吸引や凍結乾燥等の操作によりペースト状あるいは粉末状にして使用することができる。またこれらは食品等に予め混合することもでき、また適宜製剤化してリパーゼ阻害剤として使用することができる。

【0018】

【作用】本発明は、ドッカツ、リョウキョウ、ビンロウシ、ヨウバイヒ、サンベンズおよびケツメイシの6種の生薬よりなる群から選択される一種以上の生薬の極性もしくは非極性溶媒抽出エキスを有効成分とするリパーゼ阻害剤に関する。

【0019】これらの抽出物は、従来よりリパーゼ阻害作用が高いとされる茶抽出物よりも効果が高く、これらの抽出物は合成の物質ではなく天然の植物由来のものであるため安全性の高い阻害物質を提供することができる。

【0020】またこれらの抽出物は油脂の消化吸収の阻害に基く肥満予防や、リパーゼに起因する疾患の予防、防止に利用することができる。更にこれらの抽出物はリパーゼに起因する食品等の劣化、悪臭の発生の防止に利用することができる。

【0021】

【発明の効果】本発明によれば、生体内で脂質の消化吸収を司り肥満症の鍵を握るリパーゼに対して著しく高い阻害作用を示し、これを阻害して肥満の抑制や予防に寄与し得ると共に、リパーゼに起因する食品等の劣化や悪臭発生の防止に利用することができる安全性の高いリパーゼ阻害剤が提供される。

【0022】本発明のリパーゼ阻害剤はリパーゼの活性を強力かつ有効に抑制し、合成物質と異なり天然物由来であるためより安全性が高い。

【0023】また本発明品はリパーゼ阻害による肥満防止や、リパーゼが原因で起こる種々の疾患の予防、防止に利用ことができると共に、リパーゼが原因とされる油脂の分解に伴う悪臭の防止等、食品等の劣化防止等に応用することができる。

【0024】

【実施例】以下に実施例により本発明を更に詳細に説明するが、本発明は以下の実施例にのみ限定されるものではない。

【0025】実施例1-1(リパーゼ活性測定法)

リパーゼ活性の測定は、基質に蛍光性の4-メチルウンベリフェロンのオレイン酸エステル(4-MUO)を使用し、反応によって生成した4-メチルウンベリフェロンの蛍光を測定することによって行った。

【0026】小試験官に基質である4-MUO懸濁液100 μ l、ブタリパーゼ(Sigma社製)溶液50 μ l、緩衝液50 μ lを採り、最終的に4-MUO 0.05mM、ブタリパーゼ2.2 μ g、McIlvaine緩衝液(pH7.4)の条件で37℃で20分間反応させた。0.1N塩酸1mlを添加して反応を停止させ、0.1Mクエン酸ナトリウムを2ml添加して溶液のpHを4.3付近とした後、反応によって生成した4-メチルウンベリフェロンの蛍光(励起波長320nm、蛍光波長450nm)を蛍光光度計により測定した。

【0027】実施例1-2(抽出エキスの調製)

乾燥した生薬を粉砕し、粉砕物に対して50倍量のMcIlvaine緩衝液を加え、ホモジナイザーにてホモジナイズ後、一日浸漬して抽出した。これをろ過し、そのろ液を抽出エキスとした。また生薬によっては以下のような方法にて抽出した。粉砕物に対して5倍量のヘキサンにより一日抽出脱脂し、この抽出残渣を吸引乾燥後、5倍量のテトラヒドロフランを加えて一日抽出後、ろ過し、このろ液を抽出エキスとした。

【0028】実施例1-3(抽出エキスの効果の測定)リパーゼ活性に及ぼす抽出エキスの阻害効果の測定は、前記実施例に示したリパーゼ活性の測定系に抽出エキスを添加して反応させ、活性に対する影響を調べることにby行った。

【0029】McIlvaine緩衝液にて抽出したエキスに対しては、反応系の緩衝液50 μ lの代りにエキ

ス50 μ lを添加し、THFにて抽出したエキスについては5 μ lを添加した。なお、エキスと同じ溶媒を同量添加したものを対照とし、エキス添加時の活性は対照に対する相対活性として示した。

* 前記実施例に従い、各種の生薬の抽出エキスのリパーゼ活性に及ぼす影響を調べた。その結果を表1に示す。

【0031】

【表1】

【0030】実施例1-4（各種抽出エキスの比較）*

生薬抽出物のリパーゼ活性への影響

生薬	抽出溶媒	相対活性(%)
ドッカツ	緩衝液	7
リョウキョウ	"	9
ピンロウシ	"	4
ヨウバイヒ	"	0.4
サンペンズ	THF	1
ケツメイシ	"	2
茶	緩衝液	11

【0032】茶抽出エキスについてはリパーゼ阻害作用が高いことが知られているが、表1から明らかなよう ※

※に、これらの生薬抽出エキスは茶抽出エキスよりも明らかに高いリパーゼ阻害作用を有していることが判った。